

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2003 年 1 月 3 日 (03.01.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/000660 A1(51) 国際特許分類: C07D 215/22, 239/86,  
401/12, 405/12, 409/12, 413/12, A61K 31/47, 31/4709,  
31/496, 31/517, 31/5377, A61P 35/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/06239

(22) 国際出願日: 2002 年 6 月 21 日 (21.06.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2001-190238 2001 年 6 月 22 日 (22.06.2001) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 麒麟  
麦酒株式会社 (KIRIN BEER KABUSHIKI KAISHA)  
[JP/JP]; 〒104-8288 東京都中央区新川二丁目 10 番  
1 号 Tokyo (JP).

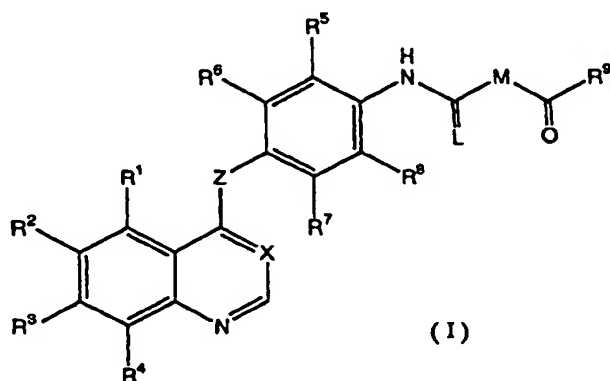
(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 藤原 康成 (FU-  
JIWARA, Yasunari) [JP/JP]; 〒370-1295 東京都渋谷区

神宮前 6-2 6-1 麒麟麦酒株式会社内 Tokyo (JP).  
千賀 照文 (SENGA, Terufumi) [JP/JP]; 〒370-0013 群  
馬県高崎市萩原町 100-1 麒麟麦酒株式会社内  
Gunma (JP). 西鳥羽 剛 (NISHITOBA, Tsuyoshi) [JP/JP];  
〒370-1295 東京都渋谷区神宮前 6-2 6-1 麒麟  
麦酒株式会社内 Tokyo (JP). 大澤 立志 (OSAWA, Tat-  
sushi) [JP/JP]; 〒370-1202 群馬県高崎市宮原町 3 麒  
麟麦酒株式会社 医薬探索研究所内 Gunma (JP). 三  
輪 篤史 (MIWA, Atsushi) [JP/JP]; 〒370-1202 群馬県  
高崎市宮原町 3 麒麟麦酒株式会社 医薬探索研究  
所内 Gunma (JP). 中村 一英 (NAKAMURA, Kazuhide)  
[JP/JP]; 〒370-1202 群馬県高崎市宮原町 3 麒麟麦酒  
株式会社 医薬探索研究所内 Gunma (JP).

(74) 代理人: 吉武 賢次, 外 (YOSHITAKE, Kenji et al.); 〒  
100-0005 東京都千代田区丸の内三丁目 2 番 3 号 富  
士ビル 323 号 協和特許法律事務所 Tokyo (JP).(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,  
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO,

[続葉有]

(54) Title: QUINOLINE DERIVATIVE AND QUINAZOLINE DERIVATIVE INHIBITING SELF-PHOSPHORYLATION OF  
HEPATOCYTUS PROLIFERATOR RECEPTOR, AND MEDICINAL COMPOSITION CONTAINING THE SAME(54) 発明の名称: 肝細胞増殖因子受容体自己リン酸化を阻害するキノリン誘導体およびキナゾリン誘導体並びにそ  
れらを含む医薬組成物

(57) Abstract: A compound having strong antitumor activity. It is a compound represented by the formula (I) or a pharmaceutically acceptable salt or solvate of the compound: (I) [wherein X is CH or nitrogen; Z is oxygen or sulfur; L is oxygen or sulfur; M is CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> (R<sup>10</sup> and R<sup>11</sup> each is hydrogen, alkyl, or alkoxy) or NR<sup>12</sup> (R<sup>12</sup> is hydrogen or alkyl); R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> each is hydrogen or optionally substituted alkoxy; R<sup>4</sup> is hydrogen; R<sup>5</sup> to R<sup>8</sup> each is hydrogen, halogeno, alkoxy, etc.; and R<sup>9</sup> is -R<sup>14</sup>, alkyl optionally substituted by -T-R<sup>15</sup> or -NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup> (T is oxygen, sulfur, or NH; R<sup>14</sup> is an optionally substituted carbon ring or heterocycle; and R<sup>15</sup> to R<sup>17</sup> each is alkyl or an optionally substituted carbon ring or heterocycle), -NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup> (R<sup>18</sup> and R<sup>19</sup> each is hydrogen, optionally substituted alkyl, or an optionally substituted carbon ring or heterocycle), or an optionally substituted carbon ring or heterocycle].

[続葉有]



NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,  
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA,  
ZM, ZW.

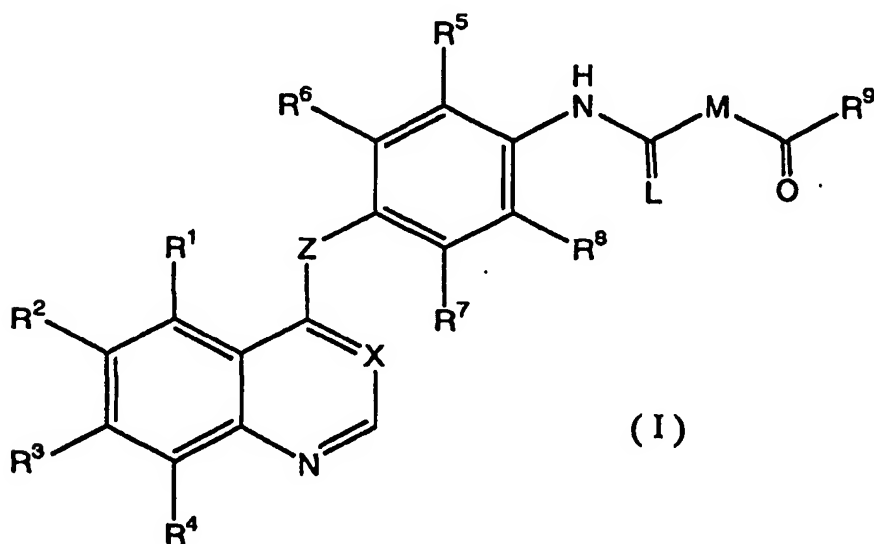
添付公開書類:  
— 国際調査報告書

- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

本発明は強力な抗腫瘍活性を有する化合物の提供をその目的とする。本発明による化合物は、式 (I) の化合物またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物である。



(I)

(上記式中、X=CH、N；Z=O、S；L=O、S；M=CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> (R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>=H、アルキル、アルコキシ)、NR<sup>12</sup> (R<sup>12</sup>=H、アルキル)；R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>=H、置換可能なアルコキシ；R<sup>4</sup>=H；R<sup>4</sup>=H、ハロゲン、アルコキシ等；R<sup>5</sup>=-R<sup>10</sup>、-T-R<sup>10</sup>または-NR<sup>12</sup>R<sup>10</sup>により置換されているもよいアルキル (T=O、S、NH；R<sup>10</sup>=置換可能な炭素環または複素環；R<sup>10</sup>=アルキル、置換可能な炭素環または複素環)、-NR<sup>12</sup>R<sup>10</sup> (R<sup>10</sup>、R<sup>12</sup>=H、置換可能なアルキル、置換可能な炭素環または複素環)、置換可能な炭素環または複素環)